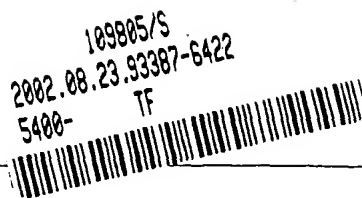




MAGYAR SZABADALMI HIVATAL

Budapest V., Garibaldi utca 2. • 1370 Budapest 5. Pf. 552  
Telefon: 312 4400 • Telefax: 131 2596  
Adószám: 15311746241 SZJ 15 Közigazgatás



Ügyiratszám:  
P0103109 /8  
Ügyintéző:  
dr. Mikló K.

Török Ferenc, DANUBIA Szabadalmi  
és Védjegy Iroda Kft.

Budapest  
Bajcsy-Zs. út 16.  
1051

Tárgy: Értesítés újdonságkutatás elvégzéséről (A3)

É R T E S Í T É S

Bejelentő:  
Research Triangle Institute, Research Triangle Park, North Carolina (US)

Képviselő:  
Török Ferenc, DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.

A találmány címe:  
Hormon és antihormon hatású 17béta-amino- és hidroxil-amino-11béta-aril-szteroid-származékok és eljárás e vegyületek előállítására

A bejelentés napja: 1999. május 28.

A közzététel napja: 2002. január 28.

A Magyar Szabadalmi Hivatal az 1995. évi XXXIII. törvény (Szt.) 69.§-ának (4) bekezdése alapján az újdonságkutatás elvégzéséről hatósági tájékoztatást közöl a Szabadalmi Közlöny és Védjegyértesítő 2002. évi 9. számában,

2002. szeptember 30. napján.

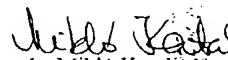
Egyben a Hivatal az Szt. 69.§-ának (3) bekezdése alapján az újdonságkutatási jelentést a hivatkozott iratok másolataival együtt megküldi a bejelentőnek.

A Hivatal egyúttal tájékoztatja a bejelentőt, hogy az érdemi vizsgálatot - ha korábban nem kérték - legkésőbb az újdonságkutatás elvégzéséről közölt hatósági tájékoztatás fent megjelölt napjától számított hat hónap elteltéig lehet kérni.

Az érdemi vizsgálatra irányuló kérelem elmaradása esetén úgy kell tekinteni, hogy a bejelentő lemondott az ideiglenes szabadalmi oltalomról.

Budapest, 2002. augusztus 22.

Melléklet: - újdonságkutatási jelentés  
3 db hivatkozott irat másolata  
- nemzetközi kutatási jelentés másolata

  
dr. Mikló Katalin  
szabadalmi elbíráló



Application No. P01 03109

Category	P C T	Identification data of relevant documents	Relevant to claim No.	Classification of the application IPC 6
A	*	See the International Search Report		C07J 2100
A		HU 185,158 B (= US 4,386,085)	1 to 17	C07J 4100
A		HU 297,925 B	1 to 17	C07J 4300
A		HU 207,341 B	1 to 17	A61K 31565
				A61K 3158
				A61P 1518
				A61P 524
				Examined special field IPC 6
				C07J
				A61K
				A61P
Date: August 22, 2002		Person performing the search:		
<p>* from the PCT Search Report</p> <p><b>Categories of relevant documents:</b></p> <p>X: document comprising all the essential features of the examined solution</p> <p>Y: document comprising all the essential features of the examined solution in combination with one or two other documents</p> <p>A: document defining the state of art</p>		<p>O: document referring to public use, exploitation, oral communication, exhibition or any other type of disclosure</p> <p>P: document published prior to the Hungarian filing date but later than the priority date claimed</p> <p>E: Hungarian patent or utility model specification having an earlier priority date and being published after the priority date of the examined application</p>		
		<p>D: document cited by applicant as belonging to the state of the art in the examined application</p> <p>&amp;: document member of the same patent family (analogue)</p>		

Érvénytelen díjfizetés hiánya miatt

Ügyszám: P8602228

Bejelentés napja: 1986.05.27

Közzétételi szám: 44575

Közzététel napja: 1988.03.28

Lajstromszám: 197925

Megadás meghirdetése: 1989.04.21

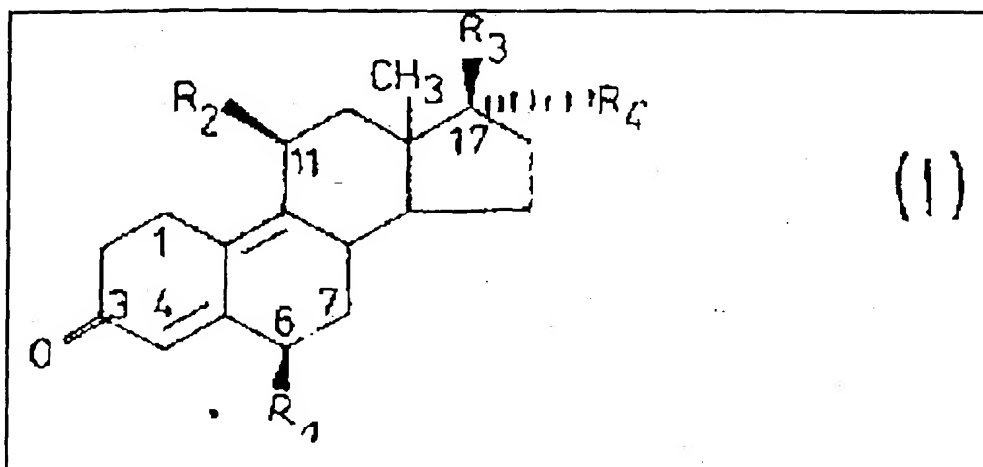
**Cím: Eljárás 11-béta-(amino-fenil)-szteroidok és az ezeket tartalmazó gyógyászati készítmények előállítására**

Jogosult: Farmitalia Carlo Erba S.p.A., Milánó, IT

Feltaláló: Faustini, Franco, Milanó, IT

D'Alessio, Roberto, Cinisello Balsamo, Villa Vittoria,, IT

Di Salle, Enrico, Milánó, IT



#### Kivonat (közzétételi):

A találmány tárgya eljárás az (I) általános képletű 11béta-szubsztituált szteroidok - a képletben

R1 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport;

R2 jelentése -A-Z általános képletű csoport, ahol

A jelentése fenil-gyűrű;

Z jelentése R5|-N|R6 általános képletű csoport,

amelyben

R5 és R6 jelentése 1-4 szénatomszámú alkilcsoport;

R3 jelentése hidroxilcsoport és

R4 jelentése 2-5 szénatomszámú alkinilcsoport - előállítására.

A találmány tárgyát képező eljárással előállítható vegyületek antiprogesteron és antiglikokortikoid hatást mutatnak és hormon-függő tumorok kezelésére alkalmazhatók.

Hungarian Patent  
Office

# NOVELTY SEARCH REPORT

Application No. P01 03109

Category	P C T	Identification data of relevant documents	Relevant to claim No.	Classification of the application IPC 6
A	*	See the International Search Report		C07J 2100
A		HU 185,158 B (= US 4,386,085)	1 to 17	C07J 4100
A		HU 297,925 B	1 to 17	C07J 4300
A		HU 207,341 B	1 to 17	A61K 31565
				A61K 3158
				A61P 1518
				A61P 524
				Examined special field IPC 6
				C07J
				A61K
				A61P
Date: August 22, 2002		Person performing the search:		
<p>* from the PCT Search Report</p> <p><b>Categories of relevant documents:</b></p> <p>X: document comprising all the essential features of the examined solution</p> <p>Y: document comprising all the essential features of the examined solution in combination with one or two other documents</p> <p>A: document defining the state of art</p>		<p>O: document referring to public use, exploitation, oral communication, exhibition or any other type of disclosure</p> <p>P: document published prior to the Hungarian filing date but later than the priority date claimed</p> <p>E: Hungarian patent or utility model specification having an earlier priority date and being published after the priority date of the examined application</p>		
		<p>D: document cited by applicant as belonging to the state of the art in the examined application</p> <p>&amp;: document member of the same patent family (analogue)</p>		

Érvénytelen oltalmi idő lejárt miatt

Ügyszám: P8103808

Bejelentés napja: 1981.12.17

Közzétételi szám: 28429

Közzététel napja: 1983.12.28

Lajstromszám: 185158

Cím: **Eljárás 11béta-szubsztituált szteroidszármazékok előállítására**

Jogosult: ROUSSEL UCLAF, Párizs (FR)

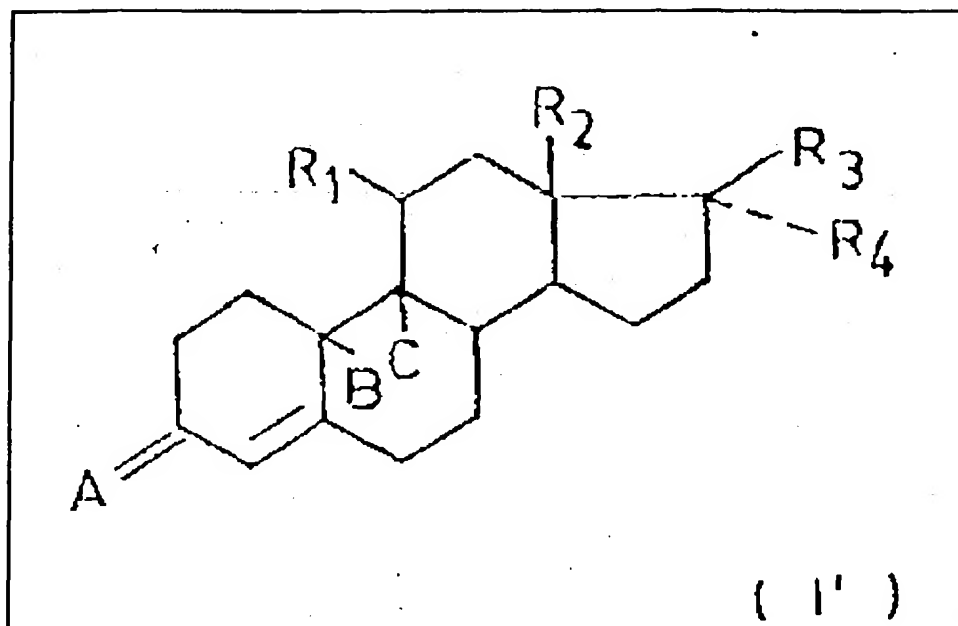
Feltaláló: Costerousse, Germain, Saint Maurice (FR)

Teutsch, Jean-Georges, Pantin (FR)

Philibert, Daniel, La Varenne/Saint Hilaire (FR)

Deraedt, Roger, Pavillons-sous-Bois (FR)

Képviselő: DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest (HU)



**Kivonat (közzétételi):**

A találmány tárgya eljárás az (I') általános képletű vegyületek, valamint savaddíciós sóik előállítására, amelyekben R1 jelentése piridilcsoport, vagy olyan fenil-csoport,

amely di-(1-4 szénatomos) alkilaminocsoporttal, trimetil-szilil-csoporttal, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos alkoxi-, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkil-, pirrolidinil-, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkil-tio-, N-(1-4 szénatomos alkil)-N-(trimetil-szilil-1-4 szénatomos alkil)-amino-, N-(1-4 szénatomos alkil)-N-[di-(1-4 szénatomos)-alkil-amino-(1-4 szénatomos)-alkil]-amino- vagy N-(1-4 szénatomos alkil)-piperazinil)-csoporttal helyettesítve van; vagy N-(1-4 szénatomos-alkil)-dihidroindolil- vagy di-(1-4 szénatomos)-alkil-amino-(1-4 szénatomos)-alkilcsoport;

R2 jelentése metilcsoport;

R3 jelentése hidroxicsoprt,

R4 jelentése adott esetben halogénatommal vagy trimetil-szililcsoporttal helyettesített, legfeljebb 8 szénatomos telítetlen szénhidrogéncsoport, vagy

R3 és R4 együttesen = N-OH-csoportot képez;

A kettős kötéssel kapcsolódik a 3-as szénatomhoz, és az így

kialakuló = C = A csoport jelentése ketocsoport, mely lehet szabad, vagy acetál formájában blokkolt, vagy = C = NOH képletű csoport; és

B és C együttesen kettős kötést vagy epoxid-hidat alkot.

Az (I') általános képletű termékek gyógyászati szempontból fontos vegyületek, mert erős antiglukokortikoid hatással rendelkeznek, továbbá progesztomimetikus, vagy anti-progesztomimetikus, illetve androgén vagy anti-androgén hatásuk van. Ezért lehetővé teszik a glukokortikoidok fokozott elválasztásából eredő rendellenességek szabályozását, pl. a magas vérnyomás, atheroszklerózis, csonttrikulás, elhízás, immundepresszió stb. kezelését. Használhatók továbbá fogamzásgátló szerek készítésére is, valamint hormon-rendellenességek kezelésére.

### ***Intézkedések***

#### **OK. Szabadalmi bejelentés közzététele (CV)**

*Intézkedés meghirdetése: 1983.12.28 (BB9A Szabadalmi bejelentések közzététele)*

Érvénytelen díjfizetés hiánya miatt

Ügyszám: P9000273

Bejelentés napja: 1990.01.25

Közzétételi szám: 55032

Közzététel napja: 1991.04.29

Lajstromszám: 207341

Megadás napja: 1992.12.04

Megadás meghirdetése: 1993.03.29

Unió elsőbbség: FR89/02384 - 1989.02.24

NSZO: C07J-041/00; C07J-043/00; A61K-031/56

**Cím:** Eljárás 11-béta helyzetben amid-, vagy karbamát-csoporttal szubsztituált szénláncot tartalmazó 19-nor-szteroidok, valamint ilyen vegyületeket hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására

**Angol cím:** PROCESS FOR PRODUCING 19-NOR-STEROIDES CONTAINING AMID-OR CARBAMATE-SUBSTITUTED CARBON-CHAIN AT THE 11-POSITION AND PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING THEM AS ACTIVE COMPONENT

**Jogosult:** ROUSSEL UCLAF S.A., Párizs (FR)

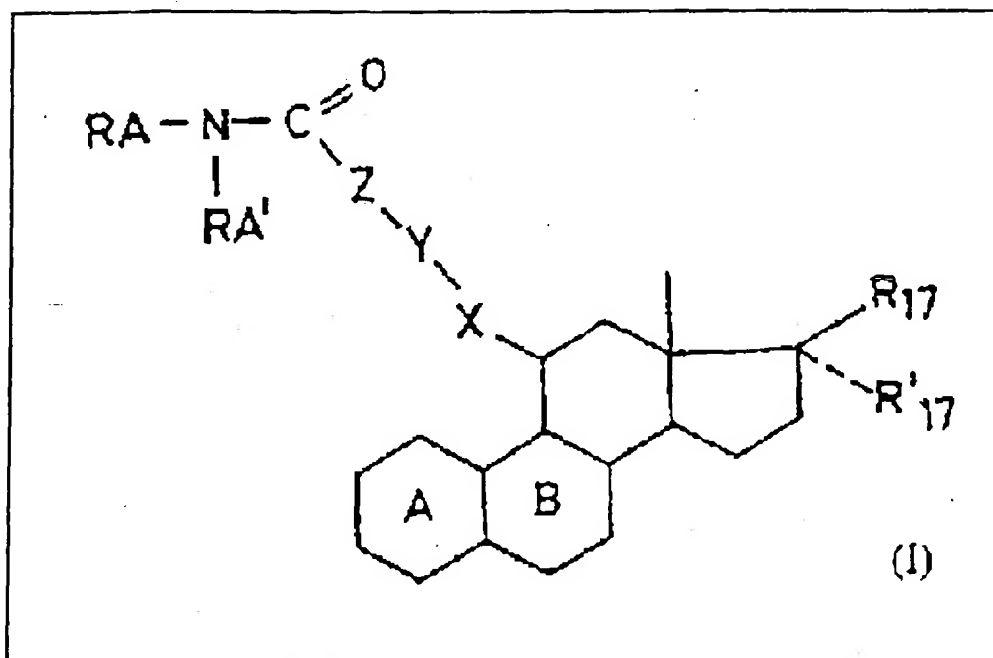
**Feltaláló:** Velde, Patrick, Párizs (FR)

Nedelec, Lucien, Le Raincy (FR)

Philibert, Daniel, La Varenne/Saint Hilaire (FR)

Claussner, André, Villemomble (FR)

**Képviselő:** DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest (HU)



**Kivonat (közzétételi):**

A találmány (I) általános képletnek megfelelő 19-nor-szteroid vegyületek, valamint ilyen vegyületeket hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására vonatkozik. Az (I) általános képletben

A és B jelentése (a) vagy (b) általános képletű csoport,  
R17 és R'17 jelentése együttesen ketoncsoport, vagy  
R17 jelentése hidroxilcsoport vagy acilcsoport és  
R'17 jelentése hidrogénatom, adott esetben szubsztituált, max. 8  
szénatomos alkil-, alkenil- vagy alkinilcsoport,  
X jelentése metilén-csoport, arilén-csoport, CH<sub>2</sub>-O csoport vagy  
arilén-oxi-csoport, amely a szteroid részhez szénatomon keresztül  
kapcsolódik,  
Y jelentése vegyértékkötés vagy alifás csoport, amely adott esetben  
egy vagy több arilén-csoporttal vagy oxigén- vagy kénatommal meg van  
szakítva,  
Z jelentése vegyértékkötés vagy CH<sub>2</sub>-O csoport, amely az Y  
csoporthoz szénatomon keresztül kapcsolódik, azzal a feltétellel,  
hogyha Y és Z jelentése vegyértékkötés, Y jelentése metilén-csoporttól  
vagy CH<sub>2</sub>-O csoporttól eltérő jelentésű,  
RA és RA' jelentése azonos vagy különböző, és lehet hidrogénatom,  
adott esetben szubsztituált alkilcsoport, továbbá  
RA és RA' jelentése a hozzájuk kapcsolódó nitrogénatommal együtt  
lehet telített vagy telítetlen, 5- vagy 6-tagú heterociklusos csoport,  
amely heteroatomként egy vagy több oxigén-, nitrogén- vagy kénatomot  
tartalmaz, és amely adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal még  
szubsztituálva lehet, azzal a feltétellel, hogy az RA és RA'  
szubsztituensek közül legalább az egyik hidrogénatomtól eltérő.  
A fenti (I) általános képletű vegyületeket a hormon terápiában  
alkalmazzák.

### Igénypont:

1. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, valamint sóik  
előállítására - a képletben
  - A+B jelentése (a) vagy (b) képletű csoport, a képletben
  - R3 jelentése hidrogénatom vagy 2-6 szénatomos alkanoilcsoport,
  - RA és RA' jelentése azonos vagy különböző és lehet hidrogénatom,  
adott esetben halogénatommal vagy di(1-4 szénatomos alkil)-  
amino-csoporttal szubsztituált vagy perhalogénezett 1-6  
szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, fenil-(1-4  
szénatomos alkil)-csoport, vagy együttesen a hozzájuk  
kapcsolódó nitrogénatommal együtt 1-4 szénatomos alkil-  
piperazinil-, pirrolidinil- vagy morfolino-csoportot  
képeznek,
  - R17 jelentése hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkanoil-oxi-csoport,  
vagy
  - R17+R'17 a 17-es szénatommal együtt CO-csoportot alkot,  
/
  - R'17 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy 2-6  
szénatomos alkinil-csoport,
  - X jelentése metilén-, fenilén- vagy fenilén-oxi-csoport,
  - Y jelentése 1-16 szénatomos egyenes vagy elágazó láncú  
alkilén-csoport, amely oxigénatommal vagy kénatommal lehet  
megszakítva, továbbá lehet 3-10 szénatomos alkinil- vagy 3-10  
szénatomos alkenilcsoport,
  - Z jelentése vegyértékkötés vagy -CH<sub>2</sub> csoport, azzal a  
megkötéssel, hogy RA és RA' szubsztituensek közül legalább  
egyik hidrogénatomtól eltérő - azzal jellemezve, hogy
  - a) a1) egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y,  
R17 és R'17 jelentése a tárgyi kör szerinti, kivéve, hogy R17  
jelentése hidroxilcsoporttól eltérő - egy (III) általános  
képletű vegyületté oxidálunk - a képletben X, Y, R17 és R'17  
jelentése a fenti - majd e kapott vegyületet a  
karboxilcsoporton való aktiválás után egy (IV) általános  
képletű vegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti  
- reagáltatunk, vagy
  - a2) egy (III) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y,  
R17 és R'17 jelentése a fenti - egy (IV) általános képletű  
vegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti -  
reagáltatunk, vagy
  - b) egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y, R17  
és R'17 jelentése a fenti - egy (IV") általános képletű



- vegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti és X' jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy
- c) egy (X) általános képletű vegyületet - a képletben W jelentése OH-csoport vagy -C = CH-csoport, és R<sub>17</sub> és R'<sub>17</sub>, ill. A' és B' jelentése azonos a fentiekben R<sub>17</sub> és R'<sub>17</sub>, ill. A és B esetében megadott jelentésekkel - egy (XI) általános képletű vegyülettel - a képletben Z, RA és RA' jelentése a fenti, Y' jelentése legalább 2 szénatomos alkilén-csoport és Hal jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy
- d) egy (X) általános képletű vegyületet - a képletben W jelentése OH-csoport - egy (XII) általános képletű vegyülettel - a képletben RA, RA', Z, Y jelentése a fenti és Hal jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy
- e) egy olyan (I) általános képletnek megfelelő vegyületet, amelynek képletében RA és RA' jelentése egyaránt hidrogénatom - N-szubsztituálunk, vagy
- f) egy (II') általános képletű vegyületet - a képletben R<sub>17</sub> és R'<sub>17</sub> és X jelentése a fenti és Y'' jelentése a fentiekben Y jelentésénél megadottnál 2 szénatommal rövidebb alkilcsoport - oxidáljuk és a kapott aldehidet egy (IV') általános képletű foszforánvegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti - reagáltatjuk, és kívánt esetben bármely fentiek szerint nyert (I) általános képletű vegyülettel valamely következő műveletet végezzük:
- i) az a) képletű csoportot aromatizálással b) képletű csoporttá alakítjuk;
- ii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportról az alkanoilcsoportot eltávolítjuk,
- iii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportot acilezzük;
- iv) a 17-es szénatomon az R<sub>17</sub>+R'<sub>17</sub> = C = O csoport-
- tot 17β-OH+17α-H csoporttá redukáljuk,
- v) a 3,17-OH csoportokat valamely OH-védőcsoporttal védjük, az RA'-H csoportot alkilezzük, majd a védőcsoportot(ka)t eltávolítjuk,
- vi) a 17α-H csoportot alkinilcsoporttá alakítjuk,
- vii) az Y helyén lévő alkinilcsoportot alkenil- vagy alkilcsoporttá redukáljuk,
- viii) a 3,17-OH csoportokat védjük, az Y csoport által képzett láncot metilezzük, majd a védőcsoportot eltávolítjuk,
- ix) bármely (I) általános képletnek megfelelő vegyületet sóvá alakítunk.
- (Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)
2. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, valamint sóik előállítására - a képletben
- A+B jelentése (a) vagy (b) képletű csoport, a képletben
- R<sub>3</sub> jelentése hidrogénatom
- RA és RA' jelentése azonos vagy különböző és lehet hidrogénatom, adott esetben halogénatommal vagy di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoporttal szubsztituált vagy perhalogénezett 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, vagy együttesen a hozzájuk kapcsolódó nitrogénatommal együtt 1-4 szénatomos alkil-piperazinil-, piperolidinil- vagy morfolino-csoportot képeznek,
- R<sub>17</sub> jelentése hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkanoil-oxi-csoport, vagy
- R<sub>17</sub>+R'<sub>17</sub> a 17-es szénatommal együtt CO-csoportot alkot,
- R'<sub>17</sub> jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkinil-csoport,
- X jelentése metilén-, fenilén- vagy fenilén-oxi-csoport,
- Y jelentése 1-16 szénatomos egyenes vagy elágazó láncú alkilén-csoport, amely oxigénatommal lehet megszakítva, továbbá lehet 3-10 szénatomos alkinil- vagy 3-10 szénatomos alkenilcsoport,
- Z jelentése vegyértékkötés vagy -CH<sub>2</sub>-O csoport, azzal a megkötéssel, hogy RA és RA' szubsztituensek közül legalább

egyik hidrogénatomtól eltérő - azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y, R17 és R'17 jelentése a tárgyi kör szerinti, kivéve hogy R17 jelentése hidroxilcsoporttól eltérő - egy (III) általános képletű vegyületté oxidálunk - a képletben X, Y, R17 és R'17 jelentése a fenti - majd e kapott vegyületet a karboxilcsoporton való aktiválás után egy (IV) általános képletű vegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti - reagáltatunk, és kívánt esetben bármely fentiek szerint nyert (I) általános képletű vegyülettel valamely következő műveletet végezzük:

- i) az a) képletű csoportot aromatizálással b) képletű csoporttá alakítjuk;
- ii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportról az alkanoilcsoportot eltávolítjuk,
- iii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportot acilezzük;
- iv) a 17-es szénatom az  $R17+R'17 = C = O$  csoportot  
/ 17béta-OH+17alfa-H csoporttá redukáljuk,
- v) a 3,17-OH csoportokat valamely OH-védőcsoporttal védjük, az RA'-H csoportot alkilezzük, majd a védőcsoport(oka)t eltávolítjuk,
- vi) a 17alfa-H csoportot alkinilcsoporttá alakítjuk,
- vii) az Y helyén lévő alkinilcsoportot alkenil- vagy alkilcsoporttá redukáljuk,
- viii) a 3,17-OH csoportokat védjük, az Y csoport által képzett láncot metilezzük, majd a védőcsoportot eltávolítjuk,
- ix) bármely (I) általános képletnek megfelelő vegyületet sóvá alakítunk.

(Elsőbbsége: 1989. 02. 24.)

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek, valamint sóik előállítására - amelyek képletében A+B jelentése a következő:

- a) A+B jelentése (a) általános képletű csoport, vagy
  - b) A+B (b') képletű csoport, és
- R17, R'17, RA, RA', valamint X, Y és Z jelentése az 1. igénypont szerinti - azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

4. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében R'17 jelentése hidrogénatom, etinil- vagy propinil-csoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

5. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében X jelentése metilén-csoport és Y jelentése 5-10 szénatomos egyenesláncú alkilcsoport, amely adott esetben oxigénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

6. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy kiindulási anyagként olyan (II) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben X jelentése fenilén-csoport és Y jelentése egyenesláncú 3-10 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben oxigénatommal meg van szakítva, vagy 3-10 szénatomos alkenil- vagy alkinilcsoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

7. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében X jelentése fenilén-oxi-csoport, és Y jelentése egyenesláncú 3-10 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben oxigén- vagy kénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

8. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy kiindulási anyagként olyan (IV) általános képletű vegyületet vagy (IV") általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyek képletében

RA és RA' jelentése azonosan metilcsoport,

vagy

RA jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport és RA' jelentése

butilcsoport, X' jelentése halogénatom, vagy  
RA jelentése metilcsoport és RA' jelentése izopropil-, dimetil-amino-etil-, benzil- vagy heptafluor-butyl-csoport, vagy  
RA és RA' együttesen piperazin-csoportot jelentenek, amely adott esetben a fentiek szerint N-szubsztituált, vagy lehet még pirrolidin-csoport is.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

9. Az 1. igénypont szerinti eljárás valamely következő vegyület előállítására:

N-metil-N-(2-dimetil-amino-etil)-11-[17béta-hidroxi-3-oxo-4,9-di-11béta-il]-undekán-amid,  
N-metil-N-butyl-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-oktánamid,  
N-metil-N-(1-metil-etil)-11-[3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il]-undekán-amid,  
N-metil-N-butyl-11-[3,17béta-dihidroxi-19-nor(17alfa-pregna-1,3,5(10)-trién-20-in)-11béta-il]-undekán-amid,  
N-metil-N-(1-metil-etil)-11-[19-nor-3,17béta-di-hidroxi-17alfa-pregna-1,3,5(10)-trién-20-in-11béta-il]-undekán-amid,  
2-[[8-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-oktil]-oxi]-N-metil-N-(1-metil-etil)-acetamid,  
N-metil-N-butyl-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenoxi]-oktánamid,  
N-metil-N-butyl-2-[5-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenoxi]-pentil-oxi]-acetamid,  
2-[[7-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-6-heptinil]-oxi]-N-butyl-N-metil-acetamid,  
N-metil-N-(2,2,3,3,4,4,4-heptafluor-butyl)-11-[3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il]-undekán-amid,  
8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-N-butyl-N-metil-oktánamid,  
azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

10. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási anyagként, amelynek képletében R'17 jelentése hidrogénatom, etinil- vagy propinilcsoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

11. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási vegyületként, amelynek képletében W jelentése -C = CH csoport, és Y jelentése telített lineáris 5-10 szénatomos alkilén-csoport, amely adott esetben oxigénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

12. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási vegyületként, amelynek képletében W jelentése OH-csoport, és olyan (XII) általános képletű vegyületet, amelynek képletében Y jelentése 3-10 szénatomos telített, egyenesláncú alkilén-csoport, amely adott esetben oxigén- vagy kénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

13. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (XI) vagy (XII) általános képletű vegyületet alkalmazunk alkilezőszerként, amelynek képletében

RA és RA' jelentése azonos és jelentése metilcsoport, vagy  
RA jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és RA' jelentése butylcsoport, vagy  
RA jelentése metilcsoport és RA' jelentése izopropil-, dimetil-amino-etil-, benzil- vagy heptafluor-butyl-csoport, vagy  
RA és RA' jelentése együttesen piperazin-csoport, amely adott esetben a fentiek szerint N-szubsztituált, vagy pirrolidin-csoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

14. Az 1. igénypont szerinti eljárás valamely következő vegyület előállítására:

N-metil-N-butyl-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-oktánamid,  
N-metil-N-butyl-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-

11béta-il)-fenoxil]-oktánamid,  
 N-metil-N-butyl-2-[[5-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-  
 11béta-il)-fenoxil]-pentil-oxil]-acetamid,  
 2-[[7-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-  
 6-heptinil]-oxil]-N-butyl-N-metil-acetamid,  
 8-[4-(3,17béta-dihidroxi-öszttra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-N-  
 butyl-N-metil-oktánamid

azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási anyagokat alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

15. Eljárás gyógyszerkészítmény előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, az 1. igénypont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületet

- a képletben A, B, R<sup>17</sup>, R'<sup>17</sup>, R'<sup>17'</sup>, RA, RA', Z, Y és X jelentése az 1. igénypont szerinti - gyógyszerészetileg elfogadható hordozóanyaggal és/vagy egyéb segédanyagokkal összekeverünk és adagolásra alkalmas gyógyszerkészítménnyé alakítunk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

16. Eljárás gyógyszerkészítés...

## **Intézkedések**

### **0K. Szabadalmi bejelentés közzététele (CV)**

*Intézkedés meghirdetése:* 1991.04.29 (BB9A Szabadalmi bejelentések közzététele)

### **0. Szabadalom megadása (BZ)**

*Intézkedés kelte:* 1992.12.04 *meghirdetése:* 1993.03.29 (FG4A Megadott szabadalmak)

### **2. Végleges szabadalmi oltalom megszűnése díjfizetés elmulasztása miatt (EZ)**

*Intézkedés kelte:* 1994.09.15 *átvétele:* 1994.09.16 *meghirdetése:* 1994.10.28 (MM4A Végleges szabadalmi oltalom megszűnése díjfizetés hiányában)